

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/JP2003/008084



# PCT

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference <b>PCT-A0326</b>	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Form PCT/IPEA/416	
International application No. <b>PCT/JP2003/008084</b>	International filing date ( <i>day/month/year</i> ) <b>26 June 2003 (26.06.2003)</b>	Priority date ( <i>day/month/year</i> ) <b>28 June 2002 (28.06.2002)</b>
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC <b>A61K 31/4035, A61P 3/10, 9/00, 9/10, 13/12, 27/02, 43/00</b>		
Applicant <b>KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.</b>		

- This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.
- This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
  - ☐ (*sent to the applicant and to the International Bureau*) a total of \_\_\_\_\_ sheets, as follows:
    - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
    - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
  - ☐ (*sent to the International Bureau only*) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).

- This report contains indications relating to the following items:

- ☒ Box No. I Basis of the report
- ☐ Box No. II Priority
- ☒ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
- ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- ☐ Box No. VI Certain documents cited
- ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
- ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand <b>19 January 2004 (19.01.2004)</b>	Date of completion of this report <b>12 May 2004 (12.05.2004)</b>
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/008084

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:

- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
- ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
- ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

☒ The international application as originally filed/furnished

☐ the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished  
 pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_  
 pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ the claims:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished  
 pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19  
 pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_  
 pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished  
 pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_  
 pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/008084

## Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

- ☐ the entire international application.
- ☒ claims Nos. 11-15

because:

- ☒ the said international application, or the said claims Nos. 11-15 relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

See supplemental sheet

- ☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

- ☐ the claims, or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed.

- ☒ no international search report has been established for said claims Nos. 11-15

- ☐ the nucleotide and/or amino acid sequence listing does not comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions in that:

the written form

- ☐ has not been furnished

- ☐ does not comply with the standard

the computer readable form

- ☐ has not been furnished

- ☐ does not comply with the standard

- ☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in computer readable form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions.

- ☐ see Supplemental Box for further details.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.  
PCT/JP 03/08084

**Supplemental Box**  
(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: III.1

Claims 11-15 pertain to methods for the treatment of the human body by therapy, and thus relate to a subject matter for which this International Preliminary Examining Authority is not required to carry out an international preliminary examination.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.  
PCT/JP 03/08084

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

### 1. Statement

Novelty (N)	Claims	5, 6	YES
	Claims	1-4, 7-10, 16	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-10, 16	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-10, 16	YES
	Claims		NO

### 2. Citations and explanations

Document 1: WO 01/62295 A1  
Document 2: EP 1179342 A1  
Document 3: JP 2000-26292 A

The inventions set forth in claims 1-4, 7-10 and 16 are disclosed in document 1 cited in the international search report; therefore they lack novelty and do not involve an inventive step. Document 1 indicates that 1-10 mg, preferably 5 mg, of mitiglinide be administered three times a day before meals (page 10), and that mitiglinide can be used in relation to complications arising from diabetes or the like (page 11).

The invention that is set forth in claims 5 and 6 is not disclosed in any of the documents that are cited in the international search report; therefore, it is novel.

Claim 5 does not involve an inventive step in the light of documents 1-3 cited in the international search report. Claim 5 pertains to compositions that comprise a calcium salt hydrate of mitiglinide as an active ingredient, and document 1 does not disclose such compositions. However, the feature of using mitiglinide as a calcium salt hydrate is disclosed in documents 2 and 3 (entire text); therefore it would be easy for a person skilled in the art to conceive of substituting a calcium

salt hydrate of mitiglinide for the mitiglinide that is disclosed in document 1 in the light of the disclosures of documents 2 and 3.

Claim 6 does not involve an inventive step in the light of documents 1-3 cited in the international search report. Claim 6 pertains to compositions that exhibit a drug dissolution characteristic in a first solution whereby 75% of the drug is released within 20 minutes, as measured by means of the dissolution test presented in *The Japanese Pharmacopoeia*, and document 1 does not disclose such compositions. However, medicinal compositions comprising mitiglinide, which exhibit a drug dissolution of 75% within 20 minutes, are disclosed in documents 2 and 3 (entire text); therefore, it would be easy for a person skilled in the art to conceive of configuring so that the medicinal compositions comprising mitiglinide that are disclosed in document 1 exhibit a drug dissolution of 75% within 20 minutes in the light of the disclosures of documents 2 and 3.

P C T

REC'D 27 MAY 2004

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）

〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 PCT-A0326	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/08084	国際出願日 (日.月.年) 26.06.2003	優先日 (日.月.年) 28.06.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup> A61K31/4035, A61P3/10, A61P9/00, A61P9/10, A61P13/12, A61P27/02, A61P43/00		
出願人 (氏名又は名称) キッセイ薬品工業株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。
3. この報告には次の附属物件も添付されている。
- a ☐ 附属書類は全部で \_\_\_\_\_ ページである。
- ☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）
- ☐ 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
- b ☐ 電子媒体は全部で \_\_\_\_\_ （電子媒体の種類、数を示す）。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。（実施細則第802号参照）

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☒ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 19.01.2004	国際予備審査報告を作成した日 12.05.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 新 留 素 子	4 P 2939
電話番号 03-3581-1101 内線 3490		

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査  
☐ PCT規則12.4にいう国際公開  
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____	ページ、	出願時に提出されたもの
第 _____	ページ*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	ページ*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____	項、	出願時に提出されたもの
第 _____	項*、	PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第 _____	項*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	項*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____	ページ/図、	出願時に提出されたもの
第 _____	ページ/図*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	ページ/図*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- |  |         |       |
|--|---------|-------|
| <input type="checkbox"/> 明細書                       | 第 _____ | ページ   |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲                     | 第 _____ | 項     |
| <input type="checkbox"/> 図面                        | 第 _____ | ページ/図 |
| <input type="checkbox"/> 配列表 (具体的に記載すること)          | _____   |       |
| <input type="checkbox"/> 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) | _____   |       |

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- |  |         |       |
|--|---------|-------|
| <input type="checkbox"/> 明細書                       | 第 _____ | ページ   |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲                     | 第 _____ | 項     |
| <input type="checkbox"/> 図面                        | 第 _____ | ページ/図 |
| <input type="checkbox"/> 配列表 (具体的に記載すること)          | _____   |       |
| <input type="checkbox"/> 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) | _____   |       |

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。



## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 11-15

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 11-15 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 11-15 は、治療による人体の処置方法に関するものであって、この国際予備審査機関が国際予備審査をすることを要しない対象に係るものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 11-15 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ スクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるスクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。

☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

## 第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)

請求の範囲

5, 6

有

請求の範囲

1-4, 7-10, 16

無

進歩性(IS)

請求の範囲

有

請求の範囲

1-10, 16

無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲

1-10, 16

有

請求の範囲

無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1. WO 01/62295 A1

文献2. EP 1179342 A1

文献3. JP 2000-26292 A

請求の範囲1-4, 7-10, 16は、国際調査報告に引用された文献1に記載されているから、新規性・進歩性を有しない。文献1の第10頁には、ミチグリニドは、1~10mg、好ましくは5mgを、1日3回、食前に投与することが記載されており、第11頁には、糖尿病性合併症等に用いることが記載されている。

請求の範囲5, 6は、国際調査報告に引用された何れの文献にも記載されていないから、新規性を有する。

請求の範囲5は、国際調査報告に引用された文献1-3により、進歩性を有しない。請求の範囲5は、有効成分がミチグリニドカルシウム塩水和物であるものに関するものであり、文献1に記載はない。しかし、ミチグリニドをカルシウム塩水和物として用いることは、文献2, 3の全文に記載の事項であるから、文献1に記載のミチグリニドを、文献2, 3の記載に基づいて、ミチグリニドカルシウム塩水和物に代えることは、当業者であれば容易に想到し得るものである。

請求の範囲6は、国際調査報告に引用された文献1-3により、進歩性を有しない。請求の範囲6は、日本薬局方の溶出試験による、第1液での薬物溶出性において、75%溶出時間が20分以下であるものに関するものであり、文献1に記載はない。しかし、ミチグリニドを含有する医薬組成物の75%溶出時間を20分以下のものとするのは、文献2, 3の全文に記載の事項であるから、文献1に記載のミチグリニドを含有する医薬組成物を、文献2, 3の記載に基づいて、75%溶出時間が20分以下のものとするのは、当業者であれば容易に想到し得るものである。